

Санкт-Петербургский государственный университет,
199034, Россия, г. Санкт-Петербург, Университетская наб., 7–9,
elenochka_yurjevna@mail.ru

ВВЕДЕНИЕ В РЕАКЦИЮ HIRE ОКС-(ТИ-)АЗЕПИНОНОВЫХ СУБСТРАТОВ С УДЛИНЕННОЙ N-АМИНОАЛКИЛЬНОЙ ЦЕПЬЮ*

Ключевые слова: циклы среднего размера, гидратированный имидазолин, расширение цикла, [1,4]окс-(ти-)азепиноны.

В настоящее время соединения, содержащие в своем составе циклы среднего размера (далее – ЦСР) (8–12 членные циклы), вызывают повышенный интерес исследователей ввиду увеличения их биодоступности, клеточной проницаемости и метаболической стабильности в сравнении с их линейными аналогами, а также циклов меньшего размера [1]. Однако в скрининговых библиотеках ЦСР практически не представлены, что объясняется их синтетической труднодоступностью. Привлекательной альтернативой традиционным методам является стратегия расширения малых циклов.

Ранее нами был опубликован подход к синтезу ЦСР исходя из N-аминоалкильных производных окс-(ти-)азепинона, идущий через стадию образования гидратированного имидазолинового интермедиата (HIRE – Hydrated Imidazoline Ring Expansion) [2].

В данной работе нами была показана возможность введения окс-(ти-)азепиноновых субстратов с удлиненной боковой цепью в реакцию HIRE (рисунок). Кроме того, нами было проведено исследование влияния длины аминоалкильной цепи на скорость конверсии субстратов в реакции перегруппировки гидратированного имидазолинового фрагмента.

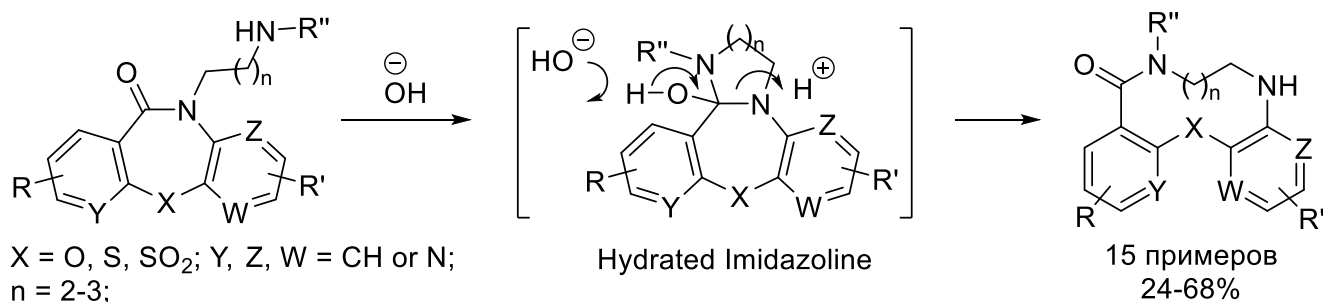


Рисунок. Схема реакции HIRE с получением 11-, 12-членных лактамов

Кроме того нами было проведено сравнение скорости конверсии тиазепиноновых субстратов с серой в окисленной до сульфона и неокисленной формах.

Таким образом, нами были расширены границы применения реакции HIRE.

Список литературы

1. *Rezai T. et al.* Testing the conformational hypothesis of passive membrane permeability using synthetic cyclic peptide diastereomers // *J. Am. Chem. Soc.* 2006. Vol. 128, №. 8. P. 2510–2511.
2. *Reutskaya E. et al.* Rethinking Hydrolytic Imidazoline Ring Expansion: A Common Approach to the Preparation of Medium-Sized Rings via Side-Chain Insertion into [1.4] Oxa- and [1.4] Thiazepinone Scaffolds // *The Journal of Organic Chemistry*. 2019. Vol. 84, № 4. P. 1693–1705.

* Работа выполнена при поддержке гранта РФФИ (№ 19-33-90010).

УДК 547.78

Д. А. Савельев, Н. А. Галиева, М. Д. Безгина,
Т. В. Березкина, В. А. Бакулев

Уральский федеральный университет
им. первого Президента России Б. Н. Ельцина,
620078, Россия, г. Екатеринбург, ул. Мира, 28,
Dimaamid1418@gmail.com

СИНТЕЗ N-СУЛЬФАНИЛАМИДИНОВ, СОДЕРЖАЩИХ ТРИФТОРМЕТИЛЬНУЮ ГРУППУ*

Ключевые слова: бензо[*d*]имидазолы, бензо[*d*]оксазолы, бензо[*d*]тиазолы, N-сульфониламидины.

Бензо[*d*]имида(окса или тиа)золы являются важным классом гетероциклических соединений. Данные фрагменты входят в состав множества соединений, проявляющих такие виды активности, как антимикробная, анальгетическая, противоопухолевая. Особенно важен потенциал этих веществ как анти-ВИЧ агентов.

Ранее [1] нами был описан метод синтеза N-сульфониламидинов из 2-амино-1*H*-бензо[*d*]имидазолов. На основе этих данных нами была предпринята попытка разработать метод синтеза N-сульфониламидинов **4** из 1*H*-бензо[*d*]имида(окса или тиа)золов **1**, содержащих трифторметиламидный фрагмент (рисунок).